

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2005年8月11日 (11.08.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/072746 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: A61K 31/663, A61P 19/08, 25/04, 29/00, 35/00, 35/04, 43/00, C07F 9/6561

(74) 代理人: 森田 拓, 外(MORITA, Hiroshi et al.); 〒103-8411 東京都中央区日本橋本町二丁目3番11号 アステラス製薬株式会社 特許部内 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/001067

(22) 国際出願日: 2005年1月27日 (27.01.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2004-024118 2004年1月30日 (30.01.2004) JP

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NL, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): アステラス製薬株式会社 (Astellas Pharma Inc.) [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目3番11号 Tokyo (JP).

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 柿元 周一郎 (KAKIMOTO, Shuichiro) [JP/JP]; 〒103-8411 東京都中央区日本橋本町二丁目3番11号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 田村 誠司 (TAMURA, Seiji) [JP/JP]; 〒103-8411 東京都中央区日本橋本町二丁目3番11号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 永倉 透記 (NAGAKURA, Yukinori) [JP/JP]; 〒103-8411 東京都中央区日本橋本町二丁目3番11号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: P2X RECEPTOR INHIBITOR

(54) 発明の名称: P2X受容体阻害剤

(57) Abstract: As the results of intensive studies of searching for a compound of a novel type inhibiting P2X<sub>2/3</sub> receptors, it is found out that minodronic acid, which is one of bisphosphonates having an effect of regulating bone resorption, has a favorable effect of inhibiting the P2X<sub>2/3</sub> receptors and is usable as a preventive or a remedy for various pains. Namely, a P2X<sub>2/3</sub> receptor inhibitor, in particular, an analgesic which contains minodronic acid or its salt as the active ingredient. The above-described "P2X<sub>2/3</sub> and/or P2X<sub>3</sub> receptor inhibitor" inhibits the functions of P2X<sub>2/3</sub> receptors which are known as molecules participating in various pains such as nociceptive pain, inflammatory pain and neurogenic pain. Owing to this effect, it is useful in preventing or treating various pains wherein the P2X<sub>2/3</sub> receptors participate in pain transmission.

(57) 要約: 本発明者等はP2X<sub>2/3</sub>受容体を阻害する新しいタイプの化合物を鋭意探索していたところ、骨吸収抑制作用を有するビスホスホネートの1種であるミノドロロン酸が良好なP2X<sub>2/3</sub>受容体阻害作用を有し、各種疼痛の予防もしくは治療剤となりうることを見出し、本発明を完成した。即ち、本発明は、ミノドロロン酸若しくはその塩を有効成分として含有するP2X<sub>2/3</sub>受容体阻害剤、殊に鎮痛剤に関するものである。本発明の、「P2X<sub>2/3</sub>及び/又はP2X<sub>3</sub>受容体阻害剤」は、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛及び神経因性疼痛の様々な痛みに関わる分子として知られているP2X<sub>2/3</sub>受容体の機能を阻害することから、P2X<sub>2/3</sub>受容体が痛みの伝達に関与している各種疼痛の予防もしくは治療に有用である。

WO 2005/072746 A1